



MAGYAR SZABADALMI HIVATAL

Budapest V., Garibaldi utca 2. • 1370 Budapest 5, Pf. 552
Telefon: 312 4400 • Telefax: 131 2596
Adószám: 15311746241 SZJ 15 Közigazgatás

189805/S
2002.08.23.93387-6422
5400- TF



Ügyiratszám:

P0103109 /8

Ügyintéző:

dr. Mikló K.

Török Ferenc, DANUBIA Szabadalmi
és Védjegy Iroda Kft.

Budapest
Bajcsy-Zs. út 16.
1051

Tárgy: Értesítés újdonságkutatás elvégzéséről (A3)

É R T E S Í T É S

Bejelentő:

Research Triangle Institute, Research Triangle Park, North Carolina (US)

Képviselő:

Török Ferenc, DANUBIA Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft.

A találmány címe:

Hormon és antihormon hatású 17béta-amino- és hidroxil-amino-11béta-aryl-szteroid-származékok és eljárás e vegyületek előállítására

A bejelentés napja: 1999. május 28.

A közzététel napja: 2002. január 28.

A Magyar Szabadalmi Hivatal az 1995. évi XXXIII. törvény (Szt.) 69. §-ának (4) bekezdése alapján az újdonságkutatás elvégzéséről hatósági tájékoztatást közöl a Szabadalmi Közlöny és Védjegyértesítő 2002. évi 9. számában,

2002. szeptember 30. napján.

02.28.

03.30

Egyben a Hivatal az Szt. 69. §-ának (3) bekezdése alapján az újdonságkutatási jelentést a hivatkozott iratok másolataival együtt megküldi a bejelentőnek.

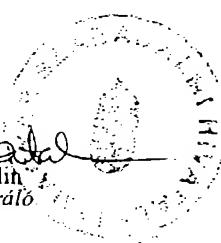
A Hivatal egyúttal tájékoztatja a bejelentőt, hogy az **érdelemi vizsgálatot** - ha korábban nem kérték - legkésőbb az újdonságkutatás elvégzéséről közölt hatósági tájékoztatás fent megjelölt napjától számított **hat hónap elteltéig** lehet kérni.

Az érdelemi vizsgálatra irányuló kérelem elmaradása esetén úgy kell tekinteni, hogy a bejelentő lemondott az ideiglenes szabadalmi oltalomról.

Budapest, 2002. augusztus 22.

Melléklet: - újdonságkutatási jelentés
- 3 db hivatkozott irat másolata
- nemzetközi kutatási jelentés másolata

Miklós Katalin
dr. Miklós Katalin
szabadalmi elbíráló



NOVELTY SEARCH REPORT

Application No. P01 03109

Category	P C T	Identification data of relevant documents	Relevant to claim No.	Classification of the application IPC 6
	*	See the International Search Report		C07J 2100
A		HU 185,158 B (= US 4,386,085)	1 to 17	C07J 4100
A		HU 297,925 B	1 to 17	C07J 4300
A		HU 207,341 B	1 to 17	A61K 31565 A61K 3158 A61P 1518 A61P 524
				Examined special field IPC 6
				C07J A61K A61P
Date: August 22, 2002		Person performing the search:		
* from the PCT Search Report		O: document referring to public use, exploitation, oral communication, exhibition or any other type of disclosure		
Categories of relevant documents:		P: document published prior to the Hungarian filing date but later than the priority date claimed		
X: document comprising all the essential features of the examined solution		E: Hungarian patent or utility model specification having an earlier priority date and being published after the priority date of the examined application		
Y: document comprising all the essential features of the examined solution in combination with one or two other documents		D: document cited by applicant as belonging to the state of the art in the examined application		
A: document defining the state of art		B: document member of the same patent family (analogue)		

Érvénytelen díjfizetés hiánya miatt

Ügyszám: P8602228

Bejelentés napja: 1986.05.27

Közzétételi szám: 44575

Közzététel napja: 1988.03.28

Lajstromszám: 197925

Megadás meghirdetése: 1989.04.21

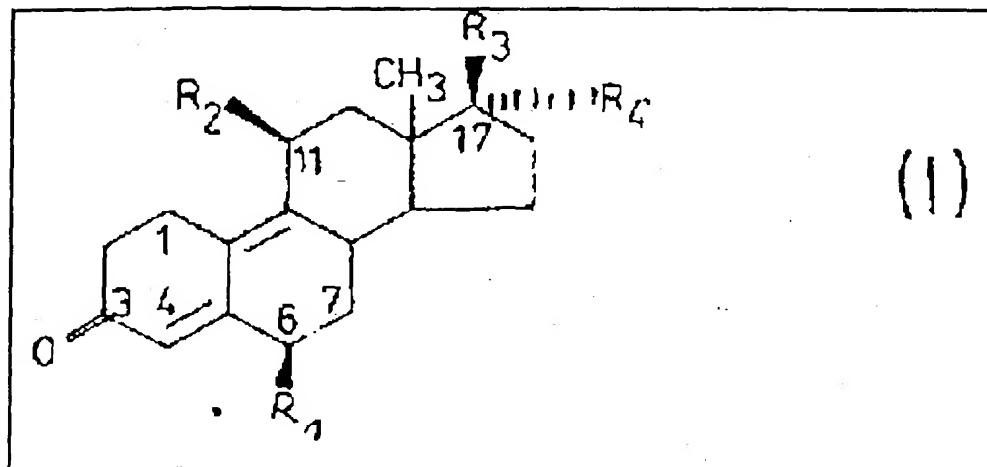
Cím: Eljárás 11-béta-(amino-fenil)-szteroidok és az ezeket tartalmazó gyógyászati készítmények előállítására

Jogosult: Farmitalia Carlo Erba S.p.A., Milánó, IT

Feltaláló: Faustini, Franco, Milanó, IT

D'Alessio, ROberto, Cinisello Balsamo, Villa Vittoria, IT

Di Salle, Enrico, Milánó, IT



Kivonat (közzétételi):

A találmány tárgya eljárás az (I) általános képletű 11béta-szubsztituált szteroidok - a képletben

R1 jelentése 1-4 szénatmos alkilcsoport;

R2 jelentése -A-Z általános képletű csoport, ahol

A jelentése fenil-gyűrű;

Z jelentése R5(-N|R6 általános képletű csoport,

amelyben

R5 és R6 jelentése 1-4 szénatomszámú alkilcsoport;

R3 jelentése hidroxilcsoport és

R4 jelentése 2-5 szénatomszámú alkinilcsoport - előállítására.

A találmány tárgyát képező eljárással előállítható vegyületek antiprogeszteron és antiglükokortikoid hatást mutatnak és hormon-függő tumorok kezelésére alkalmazhatók.

NOVELTY SEARCH REPORT

Application No. P01 03109

Category	P C T	Identification data of relevant documents	Relevant to claim No.	Classification of the application IPC 6
	*	See the International Search Report		C07J 2100
A		HU 185,158 B (= US 4,386,085)	1 to 17	C07J 4100
A		HU 297,925 B	1 to 17	C07J 4300
A		HU 207,341 B	1 to 17	A61K 31565 A61K 3158 A61P 1518 A61P 524
				Examined special field IPC 6
				C07J A61K A61P
Date: August 22, 2002		Person performing the search:		
* from the PCT Search Report		O: document referring to public use, exploitation, oral communication, exhibition or any other type of disclosure		D: document cited by applicant as belonging to the state of the art in the examined application
Categories of relevant documents:		P: document published prior to the Hungarian filing date but later than the priority date claimed		&: document member of the same patent family (analogue)
X: document comprising all the essential features of the examined solution		E: Hungarian patent or utility model specification having an earlier priority date and being published after the priority date of the examined application		
Y: document comprising all the essential features of the examined solution in combination with one or two other documents				
A: document defining the state of art				

Érvénytelen oltalmi idő lejárta miatt

Ügyszám: P8103808

Bejelentés napja: 1981.12.17

Közzétételi szám: 28429

Közzététel napja: 1983.12.28

Lajstromszám: 185158

Cím: Eljárás 11béta-szubsztituált szteroidszármazékok előállítására

Jogosult: ROUSSEL UCLAF, Párizs (FR)

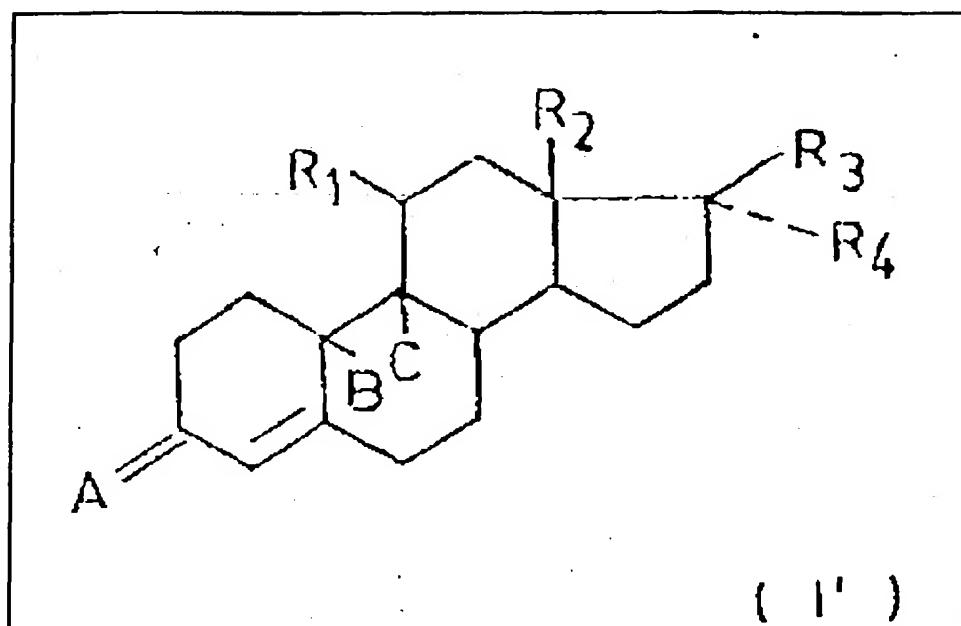
Feltaláló: Costerousse, Germain, Saint Maurice (FR)

Teutsch, Jean-Georges, Pantin (FR)

Philibert, Daniel, La Varenne/Saint Hilaire (FR)

Deraedt, Roger, Pavillons-sous-Bois (FR)

Képviselő: DANUBIA Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft., Budapest (HU)



Kivonat (közzétételi):

A találmány tárgya eljárás az (I') általános képletű vegyületek, valamint savaddíciós sóik előállítására, amelyekben R1 jelentése piridilcsoport, vagy olyan fenil-csoport,

amely di-(1-4 szénatomos) alkilaminocsoporttal, trimetil-szililcsoporttal, di-(1-4 szénatomos)-alkilamino-(1-4 szénatomos alkoxi-, di-(1-4 szénatomos)-alkilamino-(1-4 szénatomos)-alkilamino-(1-4 szénatomos)-alkil-, pirrolidinil-, di-(1-4 szénatomos)-alkilamino-(1-4 szénatomos)-alkil-, N-(1-4 szénatomos alkil)-N-(trimetil-szilil-1-4 szénatomos alkil)-amino-, N-(1-4 szénatomos alkil)-N-[di-(1-4 szénatomos)-alkil-amino-(1-4 szénatomos)-alkil]-amino- vagy N-(1-4 szénatomos alkil)-piperazinil)-csoporttal helyettesítve van; vagy N-(1-4 szénatomos-alkil)-dihidroindolil- vagy di-(1-4 szénatomos)-alkil-amino-(1-4 szénatomos)-alkilcsoport;

R2 jelentése metilcsoport;

R3 jelentése hidroxicsoport,

R4 jelentése adott esetben halogénatommal vagy trimetilszililcsoporttal helyettesített, legfeljebb 8 szénatomos telítetlen szénhidrogén-csoport, vagy

R3 és R4 együttesen = N-OH-csoportot képez;

A kettős kötéssel kapcsolódik a 3-as szénatomhoz, és az így

kialakuló = C = A csoport jelentése ketocsoport, mely lehet szabad, vagy acetál formájában blokkolt, vagy = C = NOH képletű csoport; és

B és C együttesen kettős kötést vagy epoxid-hidat alkot.

Az (I') általános képletű termékek gyógyászati szempontból fontos vegyületek, mert erős antiglukokortikoid hatással rendelkeznek, továbbá progesztomimetikus, vagy anti-progesztomimetikus, illetve androgén vagy anti-androgén hatásuk van. Ezért lehetővé teszik a glukokortikoidok fokozott elválasztásából eredő rendellenességek szabályozását, pl. a magas vérnyomás, ateroszklerózis, csontrikulás, elhízás, immundepresszió stb. kezelését. Használhatók továbbá fogamzásgátló szerek készítésére is, valamint hormon-rendellenességek kezelésére.

Intézkedések

0K. Szabadalmi bejelentés közzététele (CV)

Intézkedés meghirdetése: 1983.12.28 (BB9A Szabadalmi bejelentések közzététele)

Érvénytelen díjfizetés hiánya miatt

Ugyszám: P9000273

Bejelentés napja: 1990.01.25

Közzétételi szám: 55032

Közzététel napja: 1991.04.29

Lajstromszám: 207341

Megadás napja: 1992.12.04

Megadás meghirdetése: 1993.03.29

Uniós elsőbbség: FR89/02384 - 1989.02.24

NSZO: C07J-041/00; C07J-043/00; A61K-031/56

Cím: Eljárás 11-béta helyzetben amid-, vagy karbamát-csoporttal szubsztituált szénláncot tartalmazó 19-nor-szteroidok, valamint ilyen vegyületeket hatóanyagként tartalmazó gyógyszerkészítmények előállítására

Angol cím: PROCESS FOR PRODUCING 19-NOR-STEROIDES CONTAINING AMID- OR CARBAMATE-SUBSTITUTED CARBON-CHAIN AT THE 11- POSITION AND PHARMACEUTICAL COMPOSITION CONTAINING THEM AS ACTIVE COMPONENT

Jogosult: ROUSSEL UCLAF S.A., Párizs (FR)

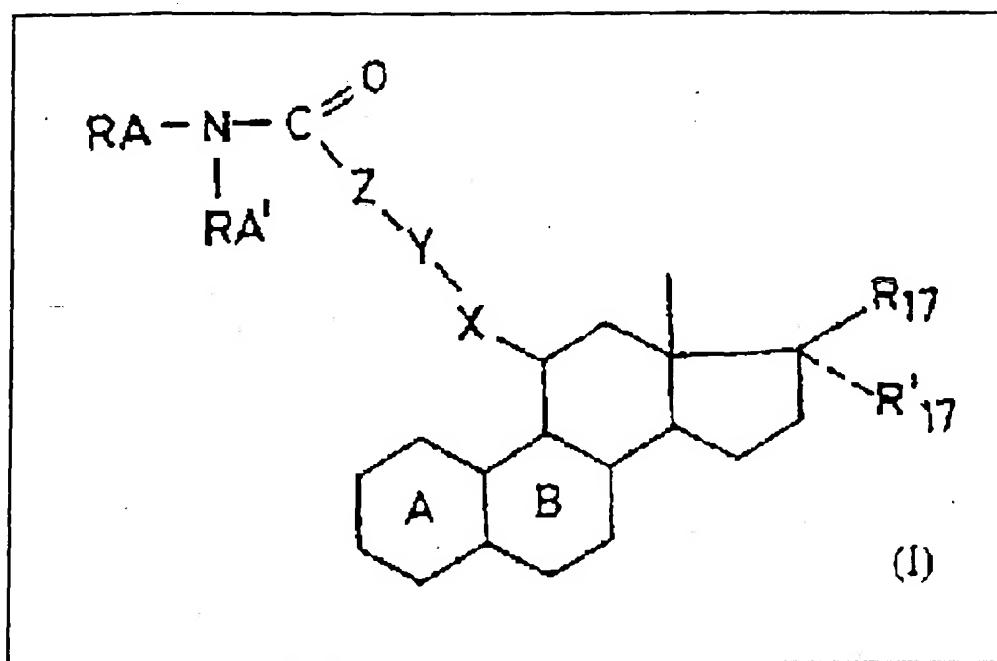
Feltaláló: Velde, Patrick, Párizs (FR)

Nedelec, Lucien, Le Raincy (FR)

Philibert, Daniel, La Varenne/Saint Hilaire (FR)

Claussner, André, Villemomble (FR)

Képviselő: DANUBIA Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft., Budapest (HU)



Kivonat (közzétételi):

A találmány (I) általános képletnek megfelelő 19-nor-szteroid vegyületek, valamint ilyen vegyületeket hatóanyagként tartalmazó gyógyszerkészítmények előállítására vonatkozik. Az (I) általános képletben

A és B jelentése (a) vagy (b) általános képletű csoport,
 R17 és R'17 jelentése együttesen ketoncsoport, vagy
 R17 jelentése hidroxilcsoport vagy acilcsoport és
 R'17 jelentése hidrogénatom, adott esetben szubsztituált, max. 8
 szénatomos alkil-, alkenil- vagy alkinilcsoport,
 X jelentése metiléncsoport, ariléncsoport, CH₂-O csoport vagy
 arilén-oxi-csoport, amely a szteroid részhez szénatomon keresztül
 kapcsolódik,

Y jelentése vegyértékkötés vagy alifás csoport, amely adott esetben
 egy vagy több ariléncsoporttal vagy oxigén- vagy kénatommal meg van
 szakítva,

Z jelentése vegyértékkötés vagy CH₂-O csoport, amely az Y
 csoporthoz szénatomon keresztül kapcsolódik, azzal a feltétellel,
 hogyha Y és Z jelentése vegyértékkötés, Y jelentése metiléncsoporttól
 vagy CH₂-O csoporttól eltérő jelentésű,

RA és RA' jelentése azonos vagy különböző, és lehet hidrogénatom,
 adott esetben szubsztituált alkilcsoport, továbbá

RA és RA' jelentése a hozzájuk kapcsolódó nitrogénatommal együtt
 lehet telített vagy telítetlen, 5- vagy 6-tagú heterociklusos csoport,
 amely heteroatomként egy vagy több oxigén-, nitrogén- vagy kénatomot
 tartalmaz, és amely adott esetben 1-4 szénatomos alkilcsoporttal még
 szubsztituálva lehet, azzal a feltétellel, hogy az RA és RA'
 szubsztituensek közül legalább az egyik hidrogénatomtól eltérő.

A fenti (I) általános képletű vegyületeket a hormon terápiában
 alkalmazzák.

Igénypont:

1. Eljárás (I) általános képletű vegyületek, valamint sóik
 előállítására - a képletben

A+B jelentése (a) vagy (b) képletű csoport, a képletben

R3 jelentése hidrogénatom vagy 2-6 szénatomos alkanoilcsoport,

RA és RA' jelentése azonos vagy különböző és lehet hidrogénatom,
 adott esetben halogénatommal vagy di(1-4 szénatomos alkil)-
 amino-csoporttal szubsztituált vagy perhalogénezett 1-6
 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxicsoport, fenil-(1-4
 szénatomos alkil)-csoport, vagy együttesen a hozzájuk
 kapcsolódó nitrogénatommal együtt 1-4 szénatomos alkil-
 piperazinil-, pirrolidinil- vagy morfolino-csoportot
 képeznek,

R17 jelentése hidroxil- vagy 1-6 szénatomos alkanoil-oxi-csoport,
 vagy

R17+R'17 a 17-es szénatommal együtt CO-csoportot alkot,
 /

R'17 jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkil- vagy 2-6
 szénatomos alkinil-csoport,

X jelentése metilén-, fenilén- vagy fenilén-oxi-csoport,

Y jelentése 1-16 szénatomos egyenes vagy elágazó láncú
 alkiléncsoport, amely oxigénatommal vagy kénatommal lehet
 megszakítva, továbbá lehet 3-10 szénatomos alkinil- vagy 3-10
 szénatomos alkenilcsoport,

Z jelentése vegyértékkötés vagy -CH₂ csoport, azzal a
 megkötéssel, hogy RA és RA' szubsztituensek közül legalább
 egyik hidrogénatomtól eltérő - azzal jellemzve, hogy

a) a1) egy (II) általános képletű vegyületet - a képletben X, Y,
 R17 és R'17 jelentése a tárgyi kör szerinti, kivéve, hogy R17
 jelentése hidroxilcsoporttól eltérő - egy (III) általános
 képletű vegyületté oxidálunk - a képletben X, Y, R17 és R'17
 jelentése a fenti - majd e kapott vegyületet a
 karboxilcsoporton való aktiválás után egy (IV) általános
 képletű vegyüettel - a képletben RA és RA' jelentése a fenti
 - reagáltatunk, vagy

a2) egy (III) általános képletű vegyületet - a képletben X, Y,
 R17 és R'17 jelentése a fenti - egy (IV) általános képletű
 vegyüettel - a képletben RA és RA' jelentése a fenti -
 reagáltatunk, vagy

b) egy (II) általános képletű vegyületet - a képletben X, Y, R17
 és R'17 jelentése a fenti - egy (IV") általános képletű

vegyülettel - a képletben RA és RA' jelentése a fenti és X' jelentése halogénatom - reagáltatunk, vagy

c) egy (X) általános képletű vegyületet - a képletben W jelentése OH-csoport vagy -C = CH-csoport, és Ra17 és Ra'17, ill. A' és B' jelentése azonos a fentiekben R17 és R'17, ill. A és B esetében megadott jelentésekkel - egy (XI) általános képletű vegyülettel - a képletben Z, RA és RA' jelentése a fenti, Y' jelentése legalább 2 szénatomos alkiléncsoport és Hal jelentése halogénatom - reagáltatunk, vagy

d) egy (X) általános képletű vegyületet - a képletben W jelentése OH-csoport - egy (XII) általános képletű vegyülettel - a képletben RA, RA', Z, Y jelentése a fenti és Hal jelentése halogénatom - reagáltatunk, vagy

e) egy olyan (I) általános képletnek megfelelő vegyületet, amelynek képletében RA és RA' jelentése egyaránt hidrogénatom - N-szubsztituálunk, vagy

f) egy (II') általános képletű vegyületet - a képletben R17 és R'17 és X jelentése a fenti és Y' jelentése a fentiekben Y jelentésénél megadottnál 2 szénatommal rövidebb alkilcsoport - oxidáljuk és a kapott aldehidet egy (IV') általános képletű foszforánvegyülettel - a képletben RA és RA' jelentése a fenti - reagáltatjuk, és kívánt esetben bármely fentiek szerint nyert (I) általános képletű vegyülettel valamely következő műveletet végezzük:

i) az a) képletű csoportot aromatizálással b) képletű csoporttá alakítjuk;

ii) a 3- és/vagy 17-hidroxilcsoportról az alkanoilcsoportot eltávolítjuk,

iii) a 3- és/vagy 17-hidroxilcsoportot acilezzük;

iv) a 17-es szénatomon az R17+R'17 = C = O csopor-

tot 17béta-OH+17alfa-H csoporttá redukáljuk,

v) a 3,17-OH csoportokat valamely OH-védőcsoporttal védjük, az RA'-H csoportot alkilezzük, majd a védőcsoportot(ka)t eltávolítjuk,

vi) a 17alfa-H csoportot alkinilcsoporttá alakítjuk,

vii) az Y helyén lévő alkinilcsoportot alkenil- vagy alkilcsoporttá redukáljuk,

viii) a 3,17-OH csoportokat védjük, az Y csoport által képzett láncot metilezzük, majd a védőcsoportot eltávolítjuk,

ix) bármely (I) általános képletnek megfelelő vegyületet sóvá alakítunk.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

2. Eljárás (I) általános képletű vegyületek, valamint sóik előállítására - a képletben

A+B jelentése (a) vagy (b) képletű csoport, a képletben

R3 jelentése hidrogénatom

RA és RA' jelentése azonos vagy különböző és lehet hidrogénatom, adott esetben halogénatommal vagy di(1-4 szénatomos alkil)-amino-csoporttal szubsztituált vagy perhalogénezett 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxicsoport, fenil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, vagy együttesen a hozzájuk kapcsolódó nitrogénatommal együtt 1-4 szénatomos alkil-piperazinil-, pirroolidinil- vagy morfolino-csoportot képeznek,

R17 jelentése hidroxil- vagy 1-6 szénatomos alkanoil-oxi-csoport, vagy

R17+R'17 a 17-es szénatommal együtt CO-csoportot alkot,

R'17 jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkil- vagy 2-6 szénatomos alkinil-csoport,

X jelentése metilén-, fenilén- vagy fenilén-oxi-csoport,

Y jelentése 1-16 szénatomos egyenes vagy elágazó láncú alkiléncsoport, amely oxigénatommal lehet megszakítva, továbbá lehet 3-10 szénatomos alkinil- vagy 3-10 szénatomos alkenilcsoport,

Z jelentése vegyértékkötés vagy -CH2-O csoport, azzal a megkötéssel, hogy RA és RA' szubsztituensek közül legalább

egyik hidrogénatomtól eltérő - azzal jellemezve, hogy egy (II) általános képletű vegyületet - a képletben X, Y, R17 és R'17 jelentése a tárgyi kör szerinti, kivéve hogy R17 jelentése hidroxilcsoporttól eltérő - egy (III) általános képletű vegyületté oxidálunk - a képletben X, Y, R17 és R'17 jelentése a fenti - majd e kapott vegyületet a karboxilcsoporton való aktiválás után egy (IV) általános képletű vegyüettel - a képletben RA és RA' jelentése a fenti - reagáltatunk, és kivánt esetben bármely fentiek szerint nyert (I) általános képletű vegyüettel valamely következő műveletet végezzük:

- i) az a) képletű csoportot aromatizálással b) képletű csoporttá alakítjuk;
- ii) a 3- és/vagy 17-hidroxilcsoportról az alkanoilcsoportot eltávolítjuk,
- iii) a 3- és/vagy 17-hidroxilcsoportot acilezzük;
- iv) a 17-es szénatom az R17+R'17 = C = O csoportot

17béta-OH+17alfa-H csoporttá redukáljuk,

- v) a 3,17-OH csoportokat valamely OH-védőcsoporttal védjük, az RA'-H csoportot alkilezzük, majd a védőcsoporto(ka)t eltávolítjuk,
- vi) a 17alfa-H csoportot alkinilcsoporttá alakítjuk,
- vii) az Y helyén lévő alkinilcsoportot alkenil- vagy alkil-csoporttá redukáljuk,
- viii) a 3,17-OH csoportokat védjük, az Y csoport által képzett láncot metilezzük, majd a védőcsoportot eltávolítjuk,
- ix) bármely (I) általános képletnek megfelelő vegyületet sóvá alakítunk.

(Elsőbbsége: 1989. 02. 24.)

3. Az 1. igénypont szerinti eljárás olyan (I) általános képletű vegyületek, valamint sóiok előállítására - amelyek képletében A+B jelentése a következő:

- a) A+B jelentése (a) általános képletű csoport, vagy
- b) A+B (b') képletű csoport, és
- R17, R'17, RA, RA', valamint X, Y és Z jelentése az 1. igénypont szerinti - azzal jellemezve, hogy a megfelelő kiindulási vegyületeket alkalmazzuk.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

4. Az 1. igénypont szerinti a) vagy b) eljárás, azzal jellemezve, hogy olyan (II) általános képletű kiindulási vegyületet alkalmazunk, amelynek képletében R'17 jelentése hidrogénatom, etinil- vagy propinil-csoport.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

5. Az 1. igénypont szerinti a) vagy b) eljárás, azzal jellemezve, hogy olyan (II) általános képletű kiindulási vegyületet alkalmazunk, amelynek képletében X jelentése metiléncsoport és Y jelentése 5-10 szénatomos egyenesláncú alkilcsoport, amely adott esetben oxigénatommal meg van szakítva.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

6. Az 1. igénypont szerinti a) vagy b) eljárás, azzal jellemezve, hogy kiindulási anyagként olyan (II) általános képletű vegyületet alkalmazunk, amelyben X jelentése feniléncsoport és Y jelentése egyenesláncú 3-10 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben oxigénatommal meg van szakítva, vagy 3-10 szénatomos alkenil- vagy alkinilcsoport.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

7. Az 1. igénypont szerinti a) vagy b) eljárás, azzal jellemezve, hogy olyan (II) általános képletű kiindulási vegyületet alkalmazunk, amelynek képletében X jelentése fenilén-oxi-csoport, és Y jelentése egyenesláncú 3-10 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben oxigén- vagy kénatommal meg van szakítva.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

8. Az 1. igénypont szerinti a) vagy b) eljárás, azzal jellemezve, hogy kiindulási anyagként olyan (IV) általános képletű vegyületet vagy (IV") általános képletű vegyületet alkalmazunk, amelyek képletében RA és RA' jelentése azonosan metilcsoport,

vagy

RA jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport és RA' jelentése

RA butilcsoport, X' jelentése halogénatom, vagy
 RA jelentése metilcsoport és RA' jelentése izopropil-, dimetil-
 amino-etyl-, benzil- vagy heptafluor-butil-csoport, vagy
 RA és RA' együttesen piperazin-csoportot jelentenek, amely adott
 esetben a fentiek szerint N-szubsztituált, vagy lehet még
 pirrolidin-csoport is.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

9. Az 1. igénypont szerinti eljárás valamely következő vegyület előállítására:

N-metil-N-(2-dimetil-amino-etyl)-11-[17béta-hidroxi-3-oxo-4,9-di-11béta-ill]-undekán-amid,
 N-metil-N-butil-8-[4-(3,17béta-dihidroxi-ösztra-1,3,5(10)-trién-11béta-ill)-fenil]-oktánamid,
 N-metil-N-(1-metil-etyl)-11-[3,17béta-dihidroxi-ösztra-1,3,5(10)-trién-11béta-ill]-undekán-amid,
 N-metil-N-butil-11-[3,17béta-dihidroxi-19-nor(17alfa-pregna-1,3,5(10)-trién-20-in)-11béta-ill]-undekán-amid,
 N-metil-N-(1-metil-etyl)-11-[19-nor-3,17béta-di-hidroxi-17alfa-pregna-1,3,5(10)-trién-20-in-11béta-ill]-undekán-amid,
 2-[[8-(3,17béta-dihidroxi-ösztra-1,3,5(10)-trién-11béta-ill)-oktil]-oxi]-N-metil-N-(1-metil-etyl)-acetamid,
 N-metil-N-butil-8-[4-(3,17béta-dihidroxi-ösztra-1,3,5(10)-trién-11béta-ill)-fenoxi]-oktánamid,
 N-metil-N-butil-2-[5-[4-(3,17béta-dihidroxi-ösztra-1,3,5(10)-trién-11béta-ill)-fenoxi]-pentil-oxi]-acetamid,
 2-[[7-[4-(3,17béta-dihidroxi-ösztra-13,5,(10)-trién-11béta-ill)-fenil]-6-heptinil]-oxi]-N-butil-N-metil-acetamid,
 N-metil-N-(2,2,3,3,4,4,4-heptafluor-butil)-11-[3,17béta-dihidroxi-ösztra-1,3,5(10)-trién-11béta-ill]-undekán-amid,
 8-[4-(3,17béta-dihidroxi-ösztra-1,3,5(10)-trién-11béta-ill)-fenil]-N-butil-N-metil-oktinamid,
 azzal jellemezve, hogy a megfelelő kiindulási vegyületeket alkalmazzuk.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

10. Az 1. igénypont szerinti c) vagy d) eljárás, azzal jellemezve, hogy olyan (X) általános képletű vegyületet alkalmazunk kiindulási anyagként, amelynek képletében R'17 jelentése hidrogénatom, etinil- vagy propinilcsoport.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

11. Az 1. igénypont szerinti c) vagy d) eljárás, azzal jellemezve, hogy olyan (X) általános képletű vegyületet alkalmazunk kiindulási vegyületként, amelynek képletében W jelentése -C = CH csoport, és olyan jelentése telített lineáris 5-10 szénatomos alkilén-csoport, amely adott esetben oxigénnel vagy kénatommal meg van szakítva.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

12. Az 1. igénypont szerinti c) vagy d) eljárás, azzal jellemezve, hogy olyan (X) általános képletű vegyületet alkalmazunk kiindulási vegyületként, amelynek képletében W jelentése OH-csoport, és olyan (XII) általános képletű vegyületet, amelynek képletében Y jelentése 3-10 szénatomos telített, egyenesláncú alkiléncsoprt, amely adott esetben oxigén- vagy kénatommal meg van szakítva.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

13. Az 1. igénypont szerinti c) vagy d) eljárás, azzal jellemezve, hogy olyan (XI) vagy (XII) általános képletű vegyületet alkalmazunk alkilezőszerként, amelynek képletében:

RA és RA' jelentése azonos és jelentése metilcsoport, vagy
 RA jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport, és RA' jelentése butilcsoport, vagy
 RA jelentése metilcsoport és RA' jelentése izopropil-, dimetil-
 amino-etyl-, benzil- vagy heptafluor-butil-csoport, vagy
 RA és RA' jelentése együttesen piperazin-csoport, amely adott esetben a fentiek szerint N-szubsztituált, vagy pirrolidin-csoport.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

14. Az 1. igénypont szerinti eljárás valamely következő vegyület előállítására:

N-metil-N-butil-8-[4-(3,17béta-dihidroxi-ösztra-1,3,5(10)-trién-11béta-ill)-fenil]-oktánamid,
 N-metil-N-butil-8-[4-(3,17béta-dihidroxi-ösztra-1,3,5(10)-trién-

11béta-il)-fenoxi]-oktánamid,
N-metil-N-butil-2-[[5-[4-(3,17béta-dihidroxi-ösztra-1,3,5(10)-trién-11béta-il)-fenoxi]-pentil-oxi]-acetamid,
2-[[7-[4-(3,17béta-dihidroxi-ösztra-1,3,5(10)-trién-11béta-il)-fenil]-6-heptinil]-oxi]-N-butil-N-metil-acetamid,
8-[4-(3,17béta-dihidroxi-ösztra-1,3,5(10)-trién-11béta-il)-fenil]-N-butil-N-metil-oktinamid

azzal jellemezve, hogy a megfelelő kiindulási anyagokat alkalmazzuk.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

15. Eljárás gyógyszerkészitmény előállítására, azzal jellemezve, hogy valamely, az 1. igény pont szerinti eljárással előállított (I) általános képletű vegyületet

- a képletben A, B, R17, R'17, R'17', RA, RA', Z, Y és X jelentése az 1.. igény pont szerinti - gyógyszerészeti leg elfogadható hordozóanyaggal és/vagy egyéb segédanyagokkal összekeverünk és adagolásra alkalmas gyógyszerkészitménnyé alakítunk.

(Elsőbbsége: 1990. 01. 25.)

16. Eljárás gyógyszerkés...

Intézkedések

0K. Szabadalmi bejelentés közzététele (CV)

Intézkedés meghirdetése: 1991.04.29 (BB9A Szabadalmi bejelentések közzététele)

0. Szabadalom megadása (BZ)

Intézkedés kelte: 1992.12.04 meghirdetése: 1993.03.29 (FG4A Megadott szabadalmak)

2. Végleges szabadalmi oltalom megszűnése díjfizetés elmulasztása miatt (EZ)

Intézkedés kelte: 1994.09.15 átvétele: 1994.09.16 meghirdetése: 1994.10.28 (MM4A Végleges szabadalmi oltalom megszűnése díjfizetés hiányában)